AU 123

47105

で特

971-05 国特許庁

ター20・71-ブ ®特許出願公告

JE 9018151 MAY 1971

昭46 (18151

(4)公告 昭和46年(1971)5月20日

SAPAN GROUP. : CLASS... 424. RECORDED

登明の数 1 (全3頁)

34795S-AB. JA-099732. . S20. All-B7. Nikken Chemicals Co Ltd.

NIKK, 11-12-69.

*JA-7118151-R.

ŧŦ 公

A96. A61; A61k (20-05-71)... DELAYED RELEASE MEDICAMENT PREPN.

NEW

Preparation of a delayed release medicament by forming granules consisting of a medicament (I), a hydrophobic substance (III) and a high m.w. substance (III) insoluble in gastric juice, and adding to them ethylcellulose and a water soluble high m.w. compound (IV), opt.adding lubricant, colouring and seasoning, homogenising and compressing the whole to form tablets.

ADVANTAGES
This process allows constant release of the active ingredient over a long period.

DETAILS

must be soluble in water to some extent. (II) may be (I) must be soluble in water to some extent. (II) may be a salt of a higher fatty acid, e.g. Mg, Ca or Al salt of stearic, palmitic or myristic acid, calcium phosphate, CaCO3, talc, alumina gel, or silicic anhydride. (III) may be polyvinyl acetate, polyvinyl (m)ethyl ether, polyethyl acrylate, polypropyl acrylate, polybutyl acrylate, polymethyl

A3-A4A, A12-V1.

534

methacrylate or silicone resin and is soluble in organic solvents. (IV) may be hydroxypropyt cellulose; hydroxypropyl methyl cellulose, methyl cellulose, NaCMC, polyvinyl alcohol, polyvinyl pyrrolidome, gelatin, gum arabic or Na arginate. The content of (II) decreases the rate of release of active substance am can be varied but should pref. be >30%. (III) should be added in an amt, of 5-15%. The ethyl cellulose and (IV) help to attain complete and constant release of the active ingredient, ethyl cellulose decreasing and (IV) increasing the release rate. Ethyl cellulose should be present in an amt, of 30-35%. The content of granules in the medicament should be <60%. (III) should

T g. ethylphenyleptine and 33 g. Mg stearate were homogeneously mixed, and the mixture was kneaded with homogeneously mixed, such that the state of 7 g. ethyspheny...
homogeneously mixed, and the mixture was kneaded with 6 g. methyl series silicone resin in 25 ml, triol. The mixture was granulated with a 30 mesh sieve and air dried. The granules ethyl cellulose (8 g. 30.80 mesh) and 40 g. 30-100 mesh hydroxypropylmethyl cellulose were homogenised and, after the addition of 0.9 g. Mg searate as lubricant, compressed to form 8 mm, 170 mg

Contd 347955

本発明は長時間継続して定められた割合で薬効 成分を放出することのできる新規な徐放性薬剤の 製造法に関する。

経口的に投与された薬物の効力を長時間に亘っ て維持することのできる薬剤はこれまでにも種々 20 のものが知られているが、その調製方法は大別す ると次の様に分けられる。即ち、

- (1) 薬物を含む 粒等を合成樹脂。ワックス等の - 消化液に難磨性ないしは不磨性の物質で被覆す る方法。
- (2) 薬物を消化液に難応性ないしは不溶性の物質 中に分散させる方法。
- (3) 薬物と消化液に難密性ないしは不容性の物質。 消化液に易溶性の物質、或いは親水性物質等と 通宜混合して圧縮する方法。

しかしながら、これらの方法には次に述べる様 に調製上、或いは使用上多くの欠点がある。即ち、 (1)の方法に於いては被獲の技術が難しいために作 業に極めて高度の熟練が必要であり、更に要求さ て行う必要があるため調製に長時間を必要とする という欠点がある。(2)の方法に於いては、薬物に 比して大量の難磨性物質を使用する必要があるた

れる欠点を改良すべく種々検討した結果。疎水性 物質。消化液に不溶性の高分子化合物。エチルセ ルローズ。及び水溶性高分子化合物を適当に組み 合せ圧縮するときは極めて性能のよい徐放性薬剤 が得られることを知見し、本発明を完成した。

本発明の方法に使用することのできる薬物とし ては多少とも水に溶解するものであればいずれも 使用することができる。

本発明は薬物、疎水性物質及び消化液に不溶性 25 の高分子化合物よりなる 粒を調製した後、これ にエチルセルローズ及び水溶性高分子化合物、及 び必要により骨沢剤、潜色剤、塩味剤等を添加し **健和した後圧縮成型することにより行われる。**

疎水性物質としては例えばスチアリン酸。パル 30 ミチン酸、ミリスチン酸等のマグネシウム塩、カ ルシウム塩、アルミニウム塩等の高級脂肪酸の塩 類及びリン酸カルシウム、炭酸カルシウム、タル ク、アルミゲル、無水ケイ酸等を用いることがで きる。また消化液に不奈性の高分子化合物は薬物、 れる被原の厚さに応じて被役操作を何回も反復し 35 疎水性物質と共に顆粒に調製する必要上有機溶媒 に可容であることが不可欠で、例えばポリ酢酸ピ ニル、ポリビニルメチルエーテル、ポリビニルエ チルエーテル、ポリアクリル酸エチル、ポリアク

AU 123

47105 971-05

国特許庁

0年許出國公告

JE 2018151 MAY 1971

昭46 € 18151 で符 許 公 (4)公告 昭和46年(1971)5月20日

JAPAN GROUP .: CLASS. AZA.

発明の数 1 (全3頁)

RECORDED 347955-AB, JA-099732, . S20, All-B7. Nikken Chemicals Co Ltd.

NIKK 11-12-69

*JA-7118151-R.

A96. A61j A61k (20-05-71)... DELAYED RELEASE MEDICAMENT PREPN

Preparation of a delayed release medicament by Preparation of a delayed release medicament by forming granules consisting of a medicament (I), a hydrophobic substance (II) and a high m.w. substance (III) insoluble in gastric juice, and adding to them ethylcellulose and a water soluble high m.w. compound (IV), opt.adding lubricant, colouring and seasoning, homogenising and compressing the whole to form tablets.

ADVANTAGES
This process allows constant release of the active ingredient over a long period.

DETAILS

(I) must be soluble in water to some extent. (II) may be a salt of a higher fatty acid, e.g. Mg. Ca or Al salt of stearic, palmitic or myristic acid, calcium phosphate, CaCO₃; talc, alumina gel, or silicic anhydride. (III) may be reclared account of the calculation of be polyrinyl acetate, polyrinyl (m)ethyl ether, polyethyl - crylate, polypropyl acrylate, polybutyl acrylate, polymethyl

A3-A4A, A12-V1.

534

methacrylate or silicone resin and is soluble in organic solvents. (IV) may be hydroxypropyl cellulose; hydroxypropyl methyl cellulose, methyl cellulose, NaCMC, polyvinyl alcohol, polyvinyl pyrrolidone, gelatin, gum arabic or Na arginate. The content of (II) decreases the rate of release of active substance can be varied but should pref, be >30%. (III) should be added in an amt. of 5-15%. The ethyl cellulose and (IV) help to attain complete and constant release of the active ingredient, ethyl cellulose decreasing and (IV) increasing the release rate. Ethyl cellulose should be present in an amt. of 30-35%. The content of granules in the medicament should be <60%. EXAMPLE

g. ethylphenylepmine and 33 g. Mg stearate were (g. curyanenyar, homogeneously mixed, and the mixture was kneaded with 6 g. methyl series silicone resin in 25 ml, triol. The mixture was granulated with a 30 mesh sieve and air dried. The granules ethyl cellulose (8 g. 30-80 mesh) and 40 g. 30-100 mesh hydroxypropylmethyl cellulose were homogenised and, after the addition of 0.9 g. Mg staggate as lubricant, compressed to form 8 mm, 170 mg homogeneously mixed, and the mixture was kneaded with Contd 347955

プロツフィノロナベロ・4 ロルフェ

本発明は長時間継続して定められた割合で変効 成分を放出することのできる新規な徐放性薬剤の 製造法に関する。

経口的に投与された薬物の効力を長時間に亘っ て維持することのできる薬剤はこれまでにも様々 20 が得られることを知見し、本発明を完成した。 のものが知られているが、その調製方法は大別す ると次の様に分けられる。即ち、

- (1) 薬物を含む 粒等を合成樹脂、ワックス等の - 消化液に難溶性ないしは不溶性の物質で被覆す る方法。
- (2) 薬物を消化液に難溶性ないしは不溶性の物質 中に分散させる方法。
- (3) 薬物と消化液に離痞性ないしは不溶性の物質、 消化液に易溶性の物質、或いは親水性物質等と 通宜混合して圧縮する方法。

しかしながら、これらの方法には次に述べる様 に調製上、或いは使用上多くの欠点がある。即ち、 (1)の方法に於いては被覆の技術が難しいために作 業に極めて高度の熟練が必要であり、更に要求さ て行う必要があるため調製に長時間を必要とする という欠点がある。(2)の方法に於いては、薬物に 比して大骨の離溶性物質を使用する必要があるた

れる欠点を改良すべく種々検討した結果。疎水性 物質、消化液に不容性の高分子化合物。エチルセ ルローズ、及び水溶性高分子化合物を適当に組み 合せ圧縮するときは極めて性能のよい徐放性薬剤

本発明の方法に使用することのできる薬物とし ては多少とも水に溶解するものであればいずれも 使用することができる。

本発明は薬物。疎水性物質及び消化液に不溶性 25 の高分子化合物よりなる 粒を調製した後、これ にエチルセルローズ及び水溶性高分子化合物、及 び必要により骨沢剤、着色剤、循味剤等を添加し 混和した後圧縮成型することにより行われる。

疎水性物質としては例えばスチアリン酸、パル 30 ミチン酸、ミリスチン酸等のマグネシウム塩、カ ルシウム塩、アルミニウム塩等の高級脂肪酸の塩 類及びリン酸カルシウム、炭酸カルシウム、タル ク、アルミゲル、無水ケイ酸等を用いることがで きる。また消化液に不溶性の高分子化合物は薬物、 れる被膜の厚さに応じて被機操作を何回も反復し 35 疎水性物質と共に顆粒に調製する必要上有機溶媒 に可容であることが不可欠で。例えばポリ酢酸ビ ニル、ポリビニルメチルエーテル、ポリビニルエ チルエーテル、ポリアクリル酸エチル、ポリアク

424-470

AU 123

47105

971-05 国特許庁

の特許出願公告

JE 0018151 MAY 1971 昭46 (18151

৺7苷 釬 公

公告 昭和46年(1971)5月20日

(全3頁)

発明の数 1

JAPAN GROUP ... CLASS .. AZA..

RECORDED 34795S-AB ALI-B7. . SZo.

NIKK, 11-12-69.

*JA-7118151-R.

Nikken Chemicals Co Ltd.

A96. . A61j A61k (20-D5-71)... DELAYED RELEASE MEDICAMENT PREPN

Preparation of a delayed release medicament by Preparation of a delayed release medicament by forming granules consisting of a medicament (I), a hydrophobic substance (II) and a high m.w. substance (III) insoluble in gastric juice, and adding to them ethylcellulose and a water soluble high m.w. compound (IV), opt.adding lubricant, colouring and seasoning, homogenising and compressing the whole to form tablets.

ADVANTAGES
This process allows constant release of the active ingredient over a long period.

(I) must be soluble in water to some extent. (II) may be a salt of a higher fatty acid, e.g. Mg, Ca or Al salt of stearic, palmitic or myristic acid, calcium phosphate, CaCO, talc, alumina gel, or silicic anhydride. (III) may be polyvinyl acetate, polyvinyl (m)ethyl ether, polyethyl acrylate, polypropyl acrylate, polybutyl acrylate, polymethyl

A3-A4A, A12-V1.

534

methacrylate or silicone resin and is soluble in organic solvents. (IV) may be hydroxypropyl cellulose; hydroxypropyl methyl cellulose, methyl cellulose, NaCMC, polyvinyl alcohol, polyvinyl pyrrolidone, gelatin, gum arabic or Na arginate. The content of (II) decreases the rate of release of active substance an can be varied but should pref. be >30%. (III) should be added in an amt. of 5-15%. The ethyl cellulose and (IV) help to attain complete and constant release of the active ingredient, ethyl cellulose decreasing and (IV) increasing the release rate. Ethyl cellulose should be present in an amt. of 30-35%. The content of granules in the medicament should be <60%.

EXAMPLE

EXAMPLE
7 g. ethylphenyleptine and 33 g. Mg stearate were homogeneously mixed, and the mixture was kneaded with 6 g. methyl series silicone resin in 25 ml. triol. The mixture was granulated with a 30 mesh sieve and air dried. The granules ethyl cellulose (8 g. 30-80 mesh) and 40 g. 30-100 mesh hydroxypropylmethyl cellulose were homogenised and, after the addition of 0.9 g. Mg stearate-as-lubricant, compressed to form 8 mm, 170 mg

プロックマンロナキロ・エロルフェ

本発明は長時間継続して定められた割合で薬効 成分を放出することのできる新規な徐放性薬剤の 製造法に関する。

経口的に投与された薬物の効力を長時間に亘つ て維持することのできる薬剤はこれまでにも様々 20 が得られることを知見し、本発明を完成した。 のものが知られているが、その調製方法は大別す ると次の様に分けられる。即ち、

- (1) 薬物を含む 粒等を合成樹脂、ワックス等の . 消化液に離磨性ないしは不密性の物質で被覆す る方法。
- (2) 薬物を消化液に離溶性ないしは不容性の物質 中に分散させる方法。
- (3) 薬物と消化液に難密性ないしは不容性の物質、 消化液に易溶性の物質、或いは親水性物質等と 適宜混合して圧縮する方法。

しかしながら、これらの方法には次に述べる様 に調製上、或いは使用上多くの欠点がある。即ち、 (1)の方法に於いては被覆の技術が難しいために作 業に極めて高度の熟練が必要であり、更に要求さ れる被願の厚さに応じて被覆操作を何回も反復し 35 疎水性物質と共に顆粒に調製する必要上有機熔媒 て行う必要があるため調製に長時間を必要とする という欠点がある。(2)の方法に於いては、薬物に 比して大量の難辞性物質を使用する必要があるた

れる欠点を改良すべく種々検討した結果。疎水性 物質。消化液に不溶性の高分子化合物。エチルセ ルローズ、及び水溶性高分子化合物を適当に組み 合せ圧縮するときは極めて性能のよい徐放性要剤

本発明の方法に使用することのできる薬物とし ては多少とも水に溶解するものであればいずれも 使用することができる。

本発明は薬物、疎水性物質及び消化液に不溶性 25 の高分子化合物よりなる 粒を調製した後、これ にエチルセルローズ及び水松性高分子化合物。及 び必要により骨沢剤、潜色剤、矯味剤等を添加し 促和した後圧縮成型することにより行われる。

疎水性物質としては例えばスチアリン酸、パル 30 ミチン酸、ミリスチン酸等のマグネシウム塩、カ ルシウム塩、アルミニウム塩等の高級脂肪酸の塩 類及びリン酸カルシウム、炭酸カルシウム、タル ク、アルミゲル、無水ケイ酸等を用いることがで きる。また消化液に不溶性の高分子化合物は塞物。 に可容であることが不可欠で、例えばポリ酢酸ビ ニル、ポリビニルメチルエーテル、ポリビニルエ チルエーテル、ポリアクリル酸エチル、ポリアク